

BASE FOR OINTMENT

Patent Number: JP57171913
Publication date: 1982-10-22
Inventor(s): ISHITANI NORIKO; others: 02
Applicant(s): SHIYOUWA YAKUHI KAKOU KK
Requested Patent: ☐ JP57171913
Application Number: JP19810057750 19810416
Priority Number(s):
IPC Classification: A61K9/06
EC Classification:
Equivalents: JP1319697C, JP60043328B

Abstract

PURPOSE:The titled tasteless stimulant-free agent haing high tack, improved application feeling, and no slippery feeling in the oral cavity in the use to wet surface, obtained by blending a paraffin type hydrocarbon compound as a main agent with a carboxyvinyl polymer as an auxiliary, and a viscosity builder.

CONSTITUTION:A paraffin type hydrocarbon compound as a main agent is blended with a carboxyvinyl polymer as an auxiliary and a viscosity builder. Vaseline, microcrystalline wax, solid paraffin, liquid paraffin, polyethylene, etc. are used as the paraffin type hydrocarbon compound as the main agnet. The carboxyvinyl polymer consists of a copolymer of acrylic acid and an allylated polyhydric alcohol, and its amount is preferably $\geq 2\text{wt}\%$ based on the main agent. The viscosity builder is a cellulose derivative, and its amount is preferably at least $\geq 10\text{wt}\%$ based on the base.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

⑩ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭57-171913

⑬ Int. Cl.³
A 61 K 9/06

識別記号

庁内整理番号
7057-4C

⑭ 公開 昭和57年(1982)10月22日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 4 頁)

⑮ 軟膏の基剤

横浜市港北区大豆戸町316-6
-3-106

⑯ 特 願 昭56-57750

⑰ 発 明 者 田中文夫

⑱ 出 願 昭56(1981)4月16日

川崎市高津区野川381-7

⑲ 発 明 者 石谷典子

⑳ 出 願 人 昭和薬品化工株式会社

川崎市高津区下野毛860昭和薬
品化工株式会社内

東京都中央区京橋1丁目16番5
号

㉑ 発 明 者 澁谷睦

㉒ 代 理 人 弁理士 中村稔 外4名

明 細 書

1. 発明の名称 軟膏の基剤

2. 特許請求の範囲

- (1) パラフィン系炭化水素化合物を主剤とし、カルボキシビニルポリマーを助剤とし、さらに増粘剤を混合し、これらを混練して得られたことを特徴とする軟膏基剤。
- (2) 主剤としてのパラフィン系炭化水素化合物がワセリン、マイクロクリスタリンワックス、固形パラフィン、流動パラフィン、またはポリエチレンであるか又はこれらの混合物であることを特徴とする特許請求の範囲第1項に記載の軟膏基剤。
- (3) 助剤としてのカルボキシビニルポリマーがアクリル酸とアリル化多価アルコールとの共重合体よりなり少くとも主剤の2重量%以上に含まれることを特徴とする特許請求の範囲第1項に記載の軟膏基剤。
- (4) 増粘剤がセルロース誘導体であつて軟膏基剤中に少くとも10重量%以上に含まれること

を特徴とする特許請求の範囲第1項に記載の軟膏基剤。

3. 発明の詳細な説明

本発明は湿润した粘膜面又は皮膚面に粘着することが可能な軟膏基剤に関する。

従来より人体皮膚面の治療剤型として粉末状、液状または軟膏状のものが使用されて来ているが、湿润面又は湿润粘膜面(例えば口腔内粘膜面など)には特殊な組成をもつ軟膏が使用されている。このような湿润面に適用される軟膏(医薬)製品は一般的にワセリンなどの油性基剤(主剤)にカルボキシメチルセルロースナトリウム(以下にCMCと略記する)などの粘着性または増粘性のある増粘剤を練和したものを基剤とし、これに対し医薬成分〔好適な例として合成副腎皮質ホルモンデキサメタゾン(0.1%)〕を配合して得られるものである。油性基剤(主剤)としてはワセリンのほか流動パラフィンまたはこれらの混合物、流動パラフィンをポリエチレンで増粘したプラスティベース(商標名)(昭和薬品化工KK販売)等

のパラフィン系炭化水素が主として使用され又、増粘剤としてCMCのほかデキストリン、アラビアガム、アルギン酸ナトリウム、ポリアクリル酸ナトリウム（以下にPANと略記する）、ペクチン、セラチン、メチルセルロース（以下にMCと略記する）、ヒドロキシプロピルセルロース（以下にHPCと略記する）、及びポリビニルアルコール等が使用されている。

既存技術としては特開昭51-38412号公報の発明があり、この特許請求の範囲に記載された発明の主要部にはワセリンのような油性化合物と、増粘剤としてPANとを用い、必要に応じて結合剤、着色剤、滑沢剤、矯味剤又は矯臭剤を添加し混合した軟膏基剤と記載されており、実施例にワセリン60%とPAN30%とを混合した軟膏基剤の例が記載されている。該既存技術の特徴としてPANの分散力、粘着性及び増粘性がすぐれたため局所に強力に付着し、膨潤した後には製剤は徐々に溶解し、含まれる薬物が殆んど均一に溶出してくることが記載されている。この既存技術の例につい

て考慮せねばならないことは軟膏基剤に混合されているPANの量であつて、PANのもつナトリウムイオンの量は相当多く、従つて配合する薬剤は制約を受けるので禁忌と予想されるものにテトラサイクリンなどがあり、酸と塩をつくる薬剤には悪い影響を与え易い。又、口腔内に使用した際にPANは特有の強いヌルヌル感を与えるから感触的な面で改良が望まれていた。

本発明者らは以上の点について種々検討した結果無機イオンを含まず、油性基剤（主剤）、粘着剤及びこれらに対して配合される医薬成分との混和性が良く、かつ分散性にすぐれた軟膏基剤であつて、これを湿潤面に適用した場合に粘着力が強く、塗布感もすぐれ、口腔内でヌルヌル感もなく、無味無刺激性の白色半透明の軟膏基剤の創製に成功した。従つて本発明の目的は該軟膏基剤を提供することにある。又、本発明の効果は該軟膏基剤が上記の優秀な諸性質を達成したことにある。

本発明の軟膏基剤は、詳しくはパラフィン系の炭化水素化合物としてワセリン又はプラスチック

ース、流動パラフィンなどの油性基剤を主剤（第一成分）とし、これに対し助剤（第二成分）としてカルボキシビニルポリマー（以下にCVPと略記する）を用い、更に第三成分として増粘剤を混合し練和することによつて製造される。

次に本発明の構成の詳細について説明する。油性基剤については上述の通りで公知のものを単独ないし組合わせて使用する。

助剤であるCVPはアクリル酸とアリル化多価アルコールとの共重合体であり、このCVPの添加が本発明の一特徴である。CVPは白色の粉末で水に接し直ちに膨潤し、徐々に溶解する。従来技術においてはCVPは専ら水系又は水相において塩基性物質との塩を作らせ、特異な増粘物質として使用されて来たものであり、本発明のごとき、原末を未加工のまま油性基剤に懸濁せしめることは行われなかつた。即ち本発明者らによればCVPは分散性にすぐれており、すなわちワセリンなどの油性基剤（主剤）と増粘剤及び医薬成分との混和性を増しかつ、これら組織相互の分散性を向上せしめ、

また同時に湿潤部に塗布した際に医薬成分の自然放出が徐々に行われるように医薬成分が均一に分散され保持される。これにより医薬効果が増大する。これらの特性はCVPの分子内に-COOH又は-OHのような附着性や分散性に寄与する極性基が存在し、一面粘着剤の親水性を抑制しているためと考えられる。又、CVPは無機の金属塩と結合していないため処方される医薬成分との相互作用においても不都合を生じるおそれが少ない。このことも本発明の大きな特徴の一つである。CVPの添加量は軟膏基剤中に少くとも2重量%、好ましくは5重量%前後の量であることが望ましく、2重量%以下の使用では粘着性が認められず、10重量%以上に使用しても粘着性の向上は認められずコストとの兼ねあいから云つて不経済である。

本発明の軟膏基剤において第三の必須成分として配合される増粘剤としては従来技術における公知の増粘剤のほとんどすべてを用いることが可能であるが、本発明者らの研究によればCMC、MC、HPC等のセルロース誘導体が適当で就中MCが好

適であつた。添加量は軟膏基剤中に少くとも10重量%以上、好ましくは20重量%前後の量であることが望ましく、上記のCVP及び油性基剤と練和して所望の稠度の軟膏基剤を得るよう調節する機能を持つが、概略15〜30重量%の量であることができる。

かくして得られた油性基剤+CVP+セルロース誘導体の三種の必須成分より成る本発明の軟膏基剤は、白色、半透明、無味、無臭、無刺激であつて処方される薬剤との不都合が少いばかりでなく、湿潤患部への付着性、更に付着部位での保着性に優れており口腔内に適用したときに、不快なヌル感がない。

しかして患部において医薬成分は確実に徐々に放出され、かつ医薬効果は長く持続する。医薬成分として配合される薬剤はインシュリン、ステロイドホルモンなどのホルモン剤、抗生物質のテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、アミノペニシリン、ペニシリン、殺菌及び消毒剤のクロルヘキシジン、ヨウ素ピロリドン、アズレン、クロロフ

イル銅ナトリウムなどである。

実施例1

プラスチックベース-50W(商標名)60.9g、カルボキシビニルポリマー3g及びメチルセルロース27gをニーダーで良く混和することによつて本発明の軟膏基剤を製造した。これとは別にブレイドニプロン0.1gとプラスチックベース-50W9gとを十分に練和したものを医薬成分とし、これを上記の軟膏基剤に加え、真空撹拌して混合しチューブに充填すると医薬としての軟膏製品が得られる。

実施例2

プラスチックベース-50W60.9g、カルボキシビニルポリマー6g及びヒドロキシプロピルメチルセルロース20gを攪拌機で良く混和して本発明の軟膏基剤を製造した。これにトリアムシノロンアセトニド(医薬成分)0.1gを全質均等に混和し、1本5g宛チューブに分注すれば医薬としての軟膏製品が得られる。

実施例3

局方ワセリン9g、マイクロクリスタリンワックス25g、局方流動パラフィン60g及びデキストリン脂肪酸エステル6gを油浴中で120℃に加熱して溶解し良く混和し、約30℃に冷却し、油性基剤とする。この油性基剤76.9g、カルボキシビニルポリマー3g及び局方カルボキシメチルセルロースNa 20gを混合し全質均等とすることにより本発明の軟膏基剤を製造した。この際に同時に局方デキサメタゾン(医薬成分)0.1gを混合しチューブに充填することにより医薬としての軟膏製品を得ることができる。

以上の実施例により製造された本発明の軟膏基剤はその中に含む油性基剤、粘着剤及び医薬成分の相互の混和性が良くかつ分散性にすぐれた軟膏(医薬)製品を与え、これを湿潤面に適用した場合に粘着力が強く塗布感もすぐれ口腔内でヌル感もなく無味で無刺激である。

手 続 補 正 書

昭和 年 56.10.10

特 許 庁 長 官 島 田 春 樹 殿

1. 事件の表示 昭和56年特許願第57750号/

2. 発明の名称 軟 膏 の 基 剤

3. 補正をする者

事件との関係 出 願 人

名 称 ショウワヤクシン カコウ
昭和薬品化工株式会社

4. 代 理 人

住 所 東京都千代田区丸の内3丁目3番1号(電話 代表 211-8741号)

氏 名 (5995)弁理士 中 村 稔

5. 補正命令の日付 自 発

6.

7. 補正の対象 明細書の特許請求の範囲の欄

8. 補正の内容 別紙記載の通り

特許請求の範囲

- (1) パラフィン系炭化水素化合物を主剤とし、カルボキシビニルポリマーを助剤とし、さらに増粘剤を混合し、これらを混練して得られたことを特徴とする軟膏基剤。
- (2) 主剤としてのパラフィン系炭化水素化合物がワセリン、マイクロクリスタリンワックス、固形パラフィン、又は流動パラフィンであるか或いはこれらの混合物であることを特徴とする特許請求の範囲第1項に記載の軟膏基剤。
- (3) 助剤としてのカルボキシビニルポリマーがアクリル酸とアリル化多価アルコールとの共重合体よりなり少くとも主剤の2重量%以上に含まれることを特徴とする特許請求の範囲第1項に記載の軟膏基剤。
- (4) 増粘剤がセルロース誘導体であつて軟膏基剤中に少くとも10重量%以上に含有されることを特徴とする特許請求の範囲第1項に記載の軟膏基剤。